

## 专利合作条约

## PCT

## 专利性国际初步报告

(PCT 第II章)

(PCT 36 和细则 70)

REC'D 03 APR 2006

WIPO

PCT

申请人或代理人的档案号 031211CP	关于后续行为 参见 PCT/IPEA/416 表	
国际申请号 PCT/CN03/01115	国际申请日(日/月/年) 25. 12 月 2003 (25.12.03)	优先权日(日/月/年) 12. 12 月 2003 (12.12.03)
国际专利分类(IPC)或者国家分类和 IPC 两种分类 参见补充栏		
申请人 中国科学院上海药物研究所 等		

1. 本报告是国际初步审查单位根据条约 35 做出的国际初步审查报告，并依照条约 36 将其传送给申请人。

2. 本报告共计 8 页，包括扉页。

3.  本报告还有附件，  
 a.  (传送给国际局和申请人) 共计 \_\_\_\_\_ 页，包含  
 修改后的并且作为本报告基础的说明书修改页、权利要求书修改页和/或附图修改页，和/或对本国际初步审查单位所做出的更正页(见 PCT 细则 70.16 和行政规程 607)。  
 国际初步审查单位认为修改超出原始公开范围的取代页，参见第 I 栏第 4 项和补充栏。  
 b.  (传送给国际局) 共计 (指明电子载体的类型和数量) \_\_\_\_\_，包含有在与序列表有关的补充栏中指明的电子形式的序列表和/或与其相关的表格。(行政规程 802)

4. 本报告包括关于下列各项的内容：

I  报告的基础  
 II  优先权  
 III  不做出关于新颖性、创造性和工业实用性的意见  
 IV  缺乏发明的单一性  
 V  按条约 35(2)关于新颖性、创造性和工业实用性的理由；支持这种意见的引证和解释  
 VI  引用的某些文件  
 VII  国际申请中的某些缺陷  
 VIII  对国际申请的某些意见

提交要求书的日期 11. 7 月 2005 (11.07.2005)	完成本报告的日期 06. 3 月 2006 (06.03.2006)
中华人民共和国国家知识产权局 IPEA/CN 中国北京市海淀区西土城路 6 号(100088) 传真号：(86-10) 62019451	受权官员  电话号码：(86-10) 62085562

## I. 报告的基础

## 1. 关于语言, 本报告将基于:

- 申请提出时使用的语言。
- 该申请的\_\_\_\_\_语言译文, 提供该种语言的译文是
  为了国际检索而提交的译文所使用的语言(细则 12.3 和 23.1 (b))。
  为了国际申请的公布而提交的译文所使用的语言(细则 12.4)。
  为了国际初步审查而提交的译文所使用的语言(细则 55.2 和/或 55.3)。

## 2. 关于国际申请中各个部分, 本报告基于(申请人为答复受理局根据条约 14 所发通知而提交的替换页, 在本报告中视为“原始提交”的文件, 不作为本报告的附件)

 原始提交的国际申请。

- 说明书, 第\_\_\_\_\_页, 原始提交的,  
     第\_\_\_\_\_页, 初审单位收到的,  
     第\_\_\_\_\_页, 初审单位收到的。
- 权利要求, 第\_\_\_\_\_页, 原始提交的,  
     第\_\_\_\_\_页, 按条约 19 条修改的(附有说明),  
     第\_\_\_\_\_页, 初审单位收到的,  
     第\_\_\_\_\_页, 初审单位收到的。
- 附图, 第\_\_\_\_\_页, 原始提交的。  
     第\_\_\_\_\_页\*, 初审单位收到的,  
     第\_\_\_\_\_页\*, 初审单位收到的。
- 序列表和/或相关表格——参见与序列表有关的补充栏。.

## 3. 修改导致以下内容的删除:

- 说明书, 第\_\_\_\_\_页
- 权利要求, 第\_\_\_\_\_项
- 附图, 第\_\_\_\_\_页, 图\_\_\_\_\_
- 序列表(具体说明) \_\_\_\_\_
- 与序列表相关的表格(具体说明) \_\_\_\_\_

4.  由于本报告附件的(某些)修改, 如下所列, 被认为超出了原始公开的范围, 如补充栏所示, 因此本报告是按照没有修改的情况做出的(细则 70.2(c))。

- 说明书, 第\_\_\_\_\_页
- 权利要求, 第\_\_\_\_\_项
- 附图, 第\_\_\_\_\_页, 图\_\_\_\_\_
- 序列表(具体说明) \_\_\_\_\_
- 与序列表相关的表格(具体说明) \_\_\_\_\_

\*如果第 4 项适用, 一些或全部的文件页可能做出“被取代”标记。

**III. 对于新颖性、创造性和工业实用性不做出审查意见**

1. 对于:

- 整个国际申请  
 权利要求 9

没有审查所要求保护的发明是否具有新颖性，创造性(非显而易见性)，或者工业实用性，

因为：

- 该国际申请，或所述权利要求 9  
涉及下列无须进行国际初步审查的主题(具体说明):  
权利要求 9 涉及对人体的治疗的治疗方法。

- 说明书、权利要求或者附图(下面特别指明的部分)或者所述权利要求  
不清楚，以致不能形成任何有意义的审查意见(具体说明):

- 权利要求书或所述权利要求 \_\_\_\_\_ 没有得到说明书的充分支持，  
以致不能形成任何有意义的审查意见。(具体说明):

- 对权利要求 \_\_\_\_\_ 没有做出任何国际检索报告。

- 没有序列表，无法进行有意义的初步审查；申请人在规定的期限内：  
 没有提交符合《行政规程》附录 C 规定标准的纸件形式的序列表，并且国际初步审查单位也未获得  
形式和方式可以接受的序列表。  
 没有提交符合《行政规程》附录 C 规定标准的电子形式的序列表，并且国际初步审查单位也未获得  
形式和方式可以接受的序列表。  
 在答复根据细则 13 条之三.1 (a) 或(b) 和 13 条之二的通知提交序列表时，没有缴纳所要求的后提交  
费用。  
 没有与序列表相关的表格，无法做出有意义的书面意见；申请人在规定的期限内没有提交符合行政规程  
附录 C 之二规定的技术要求的电子形式的表格，并且国际初步审查单位也未获得形式和方式可以接受的  
这种表格。  
 与核苷酸和/或氨基酸序列表相关的表格，如果仅以电子形式提交，不符合行政规程附录 C 之二的技术  
要求。  
 详情见补充栏。

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN03/01115

V. 按条约 35 (2)关于新颖性、创造性或工业实用性的意见；支持这种理由的引证和解释

1. 意见

新颖性(N) 权利要求 1-4 (部分), 5, 6-7 (部分), 8 是

权利要求 1-4 (部分), 6-7 (部分) 否

创造性(IS) 权利要求 1-8 (部分) 是

权利要求 1-8 (部分) 否

工业实用性(IA) 权利要求 1-8 是

权利要求 \_\_\_\_\_ 否

2. 引证和解释（细则 70.7）

参见补充栏

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN03/01115

VIII. 对国际申请的某些评论意见

就权利要求、说明书和附图的清楚性，或者权利要求是否得到说明书的充分支持提出以下意见：

权利要求 1-3 要求保护的通式化合物中对基团 Ar<sub>1</sub> 和 Ar<sub>2</sub> 的定义过宽，包括了许多种类的化合物，而实际得到说明书支持的化合物（例如 Ar<sub>1</sub> 为噻吩甲酰氨基取代的苯基的通式化合物）仅占权利要求 1-3 所要求保护化合物的极小部分。因此权利要求 1-3 得不到说明书的支持，不符合 PCT 条约第 6 条的规定。

## 补充栏

当前面的任何一栏地方不够时使用

续栏：第 V 栏第 2 节引证与解释

2.1 引用如下对比文件：

对比文件 1：JP3-50532A

对比文件 2：JP9-244229A

对比文件 3：JP11-273865A

对比文件 4：Shafi, P. M. 等， “A new synthetic route to 4-arylidene-2-phenyl-2-imidazolin-5-ones”， Indian J. Chem., Sect. B: Org. Chem. Incl. Med. Chem., 1999, 38B(3), 378-379 页

对比文件 5：Agarwal, Rajesh 等， “Synthesis of 2-aryl-1-(4-morpholinophenyl)-4-(3,4-disubstituted-benzylidene)imidazolin-5-ones as CNS active agents”， Indian J. Chem., Sect. B, 1983, 22B(3), 308-310 页

对比文件 6：Follenius-Wund, Anny 等， “Fluorescent derivatives of the GFP chromophore give a new insight into the GFP fluorescence process”， Biophysical Journal, 2003, 85(3), 1839-1850 页

对比文件 7：WO03050098A

对比文件 8：美国化学文摘， CAN: 134:115892, “Synthesis of 1,2,4-trisubstituted 2-imidazolin-5-ones”， CAS RN: 52900-70-6

对比文件 9：美国化学文摘， CAN: 132:265133, “A convenient synthesis of 4-arylidene-2-phenyl-5-oxazolones catalyzed by KF-Alumina.”， CAS RN: 14326-80-8

## 2.2 新颖性评价

对比文件1公开了一系列通式（1）化合物，其中说明书第3页表1中公开的具体化合物1-3、6-8已经落入了权利要求1的范围内，因而权利要求1不具备新颖性，不符合PCT条约33(2)的规定。同样的，对比文件2说明书第8-9页公开的化合物（17）、（18）、（22）；对比文件3说明书第5页表1和对比文件4表1中所公开的化合物均破坏了权利要求1的新颖性。对比文件5公开了一种通式（III）化合物，该化合物落入了权利要求1-3的范围内，并且公开了权利要求4、6-7的制备方法，因此权利要求1-4和6-7不具备新颖性。

此外，对比文件6表1中公开的衍生物I-3、I-11、I-15、I-17、I-19、I-20、I-21和对比文件8公开的具体化合物（CA登记号：52900-70-6）和对比文件9公开的具体化合物（CA登记号：14326-80-8）也破坏了权利要求1-2的新颖性。

由于权利要求5和8要求保护的制备方法与对比文件1-9所公开的内容不同，因此权利要求5和8具备新颖性。

## 2.3 创造性

由于权利要求1-4（部分）和6-7（部分）不具备新颖性，故而权利要求1-4（部分）和6-7（部分）不具有创造性，不符合PCT条约33(3)的规定。

## 补充栏

当前面的任何一栏地方不够时使用

续 栏：第 V 栏第 2 节引证与解释

对比文件 5 是权利要求 5（部分）、权利要求 8（部分）最接近的现有技术。考虑到对比文件 5 的教导和本领域的公知常识，本领域技术人员可以容易地得出权利要求 5 和 8（部分）的方案。因此，权利要求 5 和 8（部分）是显而易见的，不具备创造性，不符合 PCT 条约 33(3) 的规定。

对比文件 1-6 和 8-9 仅公开了部分权利要求 1 所要求保护的通式化合物，并且均未公开上述化合物具有治疗糖尿病等疾病的活性，对比文件 7 虽然公开了一系列可用于治疗 II 型糖尿病的化合物，但该化合物的杂环与权利要求 1 通式化合物的杂环结构不同。因此从权利要求 1 中排除上述对比文件所公开的化合物之后，权利要求 1（部分）相对于对比文件 1-9 是非显而易见的，权利要求 1（部分）具备创造性，符合 PCT 条约 33(3) 的规定。同样地，权利要求 2-8（部分）具备创造性，符合 PCT 条约 33(3) 的规定。

#### 2.4 工业实用性评价：

权利要求 1-8 具备工业实用性，符合 PCT 条约 33(4) 的规定。

专利性国际初步报告

国际申请号

PCT/CN03/01115

补充栏

当前面的任何一栏地方不够时使用

续 栏：国际专利分类(IPC)或者国家分类和 IPC 两种分类

C07D263/42 (2006.01) i

C07D263/46 (2006.01) i

C07D277/34 (2006.01) i

C07D277/36 (2006.01) i

C07D233/70 (2006.01) i

C07D233/84 (2006.01) i

A61K31/4164 (2006.01) i

A61K31/421 (2006.01) i

A61K31/426 (2006.01) i